

专 利 合 作 条 约

PCT

专利性国际初步报告

(PCT 第II章)

(PCT 36 和细则 70)

REC'D 23 FEB 2006

WIPO

PCT

申请人或代理人的档案号 NF20040003	关于后续行为 参见 PCT/IPEA/416 表	
国际申请号 PCT/CN2004/001064	国际申请日(日/月/年) 20.9月2004(20.09.2004)	优先权日(日/月/年) 26.9月2003(26.09.2003)
国际专利分类(IPC)或者国家分类和 IPC 两种分类 参见补充栏		
申请人 李国桥, 宋建平		

1. 本报告是国际初步审查单位根据条约 35 做出的国际初步审查报告, 并依照条约 36 将其传送给申请人。
2. 本报告共计 5 页, 包括扉页。
3. ☒ 本报告还有附件,
 - a. ☒ (传送给国际局和申请人) 共计 2 页, 包含

☐ 修改后的并且作为本报告基础的说明书修改页、权利要求书修改页和/或附图修改页, 和/对本国际初步审查单位所做出的更正页(见 PCT 细则 70.16 和行政规程 607)。
☒ 国际初步审查单位认为修改超出原始公开范围的取代页, 参见第 I 栏第 4 项和补充栏。
 - b. ☐ (传送给国际局) 共计 (指明电子载体的类型和数量) _____, 包含有在与序列列表有关的补充栏中
指明的电子形式的序列表和/或与其相关的表格。(行政规程 802)

4. 本报告包括关于下列各项的内容:

- I ☒ 报告的基础
- II ☐ 优先权
- III ☐ 不做出关于新颖性、创造性和工业实用性的意见
- IV ☐ 缺乏发明的单一性
- V ☒ 按条约 35(2)关于新颖性、创造性或工业实用性的理由; 支持这种意见的引证和解释
- VI ☐ 引用的某些文件
- VII ☒ 国际申请中的某些缺陷
- VIII ☐ 对国际申请的某些意见

提交要求书的日期 04.7月2005(04.07.2005)	完成本报告的日期 13.2月2006(13.02.2006)
中华人民共和国国家知识产权局 IPEA/ON 中国北京市海淀区西土城路 6 号(100088)	受权官员 盛倩
传真号: (86-10)62019451	电话号码 (86-10)62085235

PCT/IPBA/409 表(扉页) (2005 年 4 月)

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN2004/001064

I. 报告的基础

1. 关于语言, 本报告将基于:

☒ 中请提出时使用的语言。☐ 该中请的____语言译文, 提供该种语言的译文是☐ 为了国际检索而提交的译文所使用的语言(细则 12.3 和 23.1 (b))。☐ 为了国际申请的公布而提交的译文所使用的语言(细则 12.4)。☐ 为了国际初步审查而提交的译文所使用的语言(细则 55.2 和/或 55.3)。

2. 关于国际申请中各个部分, 本报告基于(申请人为答复受理局根据条约 14 所发通知而提交的替换页, 在本报告中视为“原始提交”的文件, 不作为本报告的附件)

☒ 原始提交的国际申请。☐ 说明书, 第_____页 原始提交的,

第_____页

初审单位收到的,

第_____页

初审单位收到的。

☐ 权利要求, 第_____页, 原始提交的,

第_____页, 按条约 19 条修改的(附有说明),

第_____页

初审单位收到的,

第_____页

初审单位收到的。

☐ 附图, 第_____页, 原始提交的。

第_____页*, _____

初审单位收到的,

第_____页*, _____

初审单位收到的。

☐ 序列表和/或相关表格——参见与序列表有关的补充栏。

3. 修改导致以下内容的删除:

☐ 说明书, 第_____页☐ 权利要求, 第_____项☐ 附图, 第_____页, 图_____☐ 序列表(具体说明)_____☐ 与序列表相关的表格(具体说明)_____4. ☒ 由于本报告附件的(某些)修改, 如下所列, 被认为超出了原始公开的范围, 如补充栏所示, 因此本报告是按照没有修改的情况做出的(细则 70.2(c))。☒ 说明书, 第_____1_____页☒ 权利要求, 第_____1, 2_____项☐ 附图, 第_____页, 图_____☐ 序列表(具体说明)_____☐ 与序列表相关的表格(具体说明)_____

*如果第 4 项适用, 一些或全部的文件页可能做出“被取代”标记。

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN2004/001064

V. 按条约 35 (2) 关于新颖性、创造性或工业实用性的意见：支持这种理由的引证和解释

1. 意见

新颖性(N)	权利要求 2	是
	权利要求 1	否
创造性(IS)	权利要求 1,2	是
	权利要求 无	否
工业实用性(IA)	权利要求 1,2	是
	权利要求 无	否

2. 引证和解释 (细则 70.7)

D1: CN,A,1305810

D1 公开了由 1 份双氢青蒿素和 6 份哌嗪组成的药物组合物，其中的双氢青蒿素可以替换为其同类物，即青蒿素，该药物组合物可以制成片剂、栓剂、颗粒剂和注射剂（参见 D1 权利要求 1-3，说明书第 2 页 9-12 行），因此，权利要求 1 中大范围的技术方案（即包括 1 份青蒿素、3-9 份哌嗪、0-0.2 份伯氨喹的技术方案）不具备新颖性(专利合作条约 PCT 33(2))。

现有技术没有公开权利要求 1 中小范围的技术方案和/或权利要求 2 的技术方案，因此，权利要求 2 具备新颖性(专利合作条约 33(2) PCT)。同时，权利要求 1 中小范围的技术方案和/或权利要求 2 的技术方案对于本领域技术人员来说是非显而易见的，因此，权利要求 1 和 2 具备创造性(专利合作条约 PCT 33(3))。

权利要求 1 和 2 可以在工业上应用，因此，具备工业实用性(专利合作条约 PCT 33(4))。

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN2004/001064

VII. 国际申请中的某些缺陷

国际申请在形式上或内容上存在下列缺陷:

权利要求 1 中存在两个不同的保护范围, 因此, 权利要求 1 是不清楚的(专利合作条约 PCT 第 6 条)。同时, 优选范围并未落在大范围之内, 即 0.6 不在 0-0.2 范围之内, 因此, 权利要求 1 还是不清楚(专利合作条约 PCT 第 6 条)。

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN2004/001064

补充栏

当前面的任何一栏地方不够时使用

续栏:

2005年7月4日提交的修改文本超出了原始申请文件记载的范围, 因为具体的数值点(例如哌嗪5份、伯氢喹0-0.05份)在原始申请文件中没有公开, 即使该数值点落在了原始公开的大范围之内, 仍然认为这样的修改是超范围的(34(2)(b)PCT)。

A61K 31/336 (2006.01) i

A61K 31/496 (2006.01) i

A61K 31/4706 (2006.01) i

A61P 33/06 (2006.01) i

PCT/IPEA/409 表(补充栏) (2005 年 4 月)

权 利 要 求 书

1. 一种复方青蒿素，其特征在于用该复方可制成片剂、儿童颗粒剂、栓剂、混悬糖浆或干粉，复方包括以下成份：青蒿素（Artemisinin）、哌喹（Piperaquine）、伯氨喹

5 (Primaquine)，三药的配伍比例范围是：

青蒿素（Artemisinin） 1 份

哌喹（Piperaquine） 5 份

伯氨喹（Primaquine） 0—0.05 份

三药的最佳配比是 1：5：0.04。

10 2. 根据权利要求 1 所述的复方青蒿素，其特征在于所述的伯氨喹还可单独制成片剂与青蒿素+哌喹的混合片剂同时服用。

修改页 IPEA/CN

复方青蒿素所属技术领域

本发明涉及治疗疟疾的药物，特别是具有高效速效疗效的复方青蒿素。

背景技术

现有技术中的治疟药物有的采用青蒿素衍生物（如双氢青蒿素、青蒿琥酯、蒿甲醚、蒿乙醚）与长半衰期的哌喹配伍，由于多量的磷酸盐对胃肠道有致恶性呕吐的副作用而影响疗效，一疗程总量分3次服用则胃肠道副反应高达10%，分4次服用可降低至3-5%。

10 现有技术的治疟药物还存在生产工艺长，成本高，药物稳定保质期短，服用量大等缺点。

发明内容

本发明的目的旨在克服现有技术的不足而提供一种具有疗程短，副作用更小，原料成本更低、服用更方便、有高效速效的复方青蒿素。

15 本发明的目的是这样实现的：

一种复方青蒿素，用该复方可制成片剂、儿童颗粒剂、栓剂、混悬糖浆或干粉，复方包括以下成份：青蒿素（Artemisinin）、哌喹（Piperaquine）、伯氨喹（Primaquine），三药的配伍比例范围是：

20	青蒿素（Artemisinin）	1 份
	哌喹（Piperaquine）	5 份
	伯氨喹（Primaquine）	0—0.05 份

三药的最佳配比是 1：5：0.04。

——所述的伯氨喹还可单独制成片剂与青蒿素+哌喹的混合片剂同时服用。

25 本发明通 600 多例临床试验，对多重抗药性恶性疟、间日疟和三日疟证明本药具有速效、高效、低毒、短疗程、快速清除传染源以阻断疟疾传播的特点，其疗效、功能明显优于目前国内外的同类药。

具体实施方式

按下述配方取量：

30	青蒿素（Artemisinin）	160g
	哌喹（Piperaquine）	750g
	伯氨喹（Primaquine）	6g
	辅料（羟丙基纤维素等）	适量
	制成	1000 片
35	制剂工艺：	

修改页 IPEA/CN